PCT/EP 9 9 / 0 2 70 9

# BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

PRIORITY

DOCUMENT

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN

COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)



REC'D 0 4 JUN 1999
WIPO PCT

Bescheinigung

GP99/2709

Die Beiersdorf Aktiengesellschaft in Hamburg/Deutschland hat eine Patentanmeldung unter der Bezeichnung

"Kosmetische und dermatologische Lichtschutformulierungen mit einem Gehalt an Triazinderivaten und einem oder mehreren Estern unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole"

am 9. Mai 1998 beim Deutschen Patent- und Markenamt eingereicht.

Das angeheftete Stück ist eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlage dieser Patentanmeldung.

Die Anmeldung hat im Deutschen Patent- und Markenamt vorläufig das Symbol A 61 K 7/42 der Internationalen Patentklassifikation erhalten.

München, den 15. April 1999

Deutsches Patent- und Markenamt

Der Präsident

im Auftrag

Dzier200



Aktenzeichen: 198 20 825.1



# Beiersdorf Aktieng sellschaft Hamburg

**\*** 

#### **Beschreibung**

Kosmetische und dermatologische Lichtschutzformulierungen mit einem Gehalt an Triazinderivaten und einem oder mehreren Estern unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole

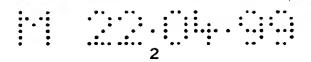
Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische und dermatologische Lichtschutzzubereitungen, insbesondere hautpflegende kosmetische und dermatologische Lichtschutzzubereitungen.

Die schädigende Wirkung des ultravioletten Teils der Sonnenstrahlung auf die Haut ist allgemein bekannt. Während Strahlen mit einer Wellenlänge, die kleiner als 290 nm ist (der sogenannte UVC-Bereich), von der Ozonschicht in der Erdatmosphäre absorbiert werden, verursachen Strahlen im Bereich zwischen 290 nm und 320 nm, dem sogenannten UVB-Bereich, ein Erythem, einen einfachen Sonnenbrand oder sogar mehr oder weniger starke Verbrennungen.

Als ein Maximum der Erythemwirksamkeit des Sonnenlichtes wird der engere Bereich um 308 nm angegeben.

Zum Schutze gegen UVB-Strahlung sind zahlreiche Verbindungen bekannt, bei denen es sich zumeist um Derivate des 3-Benzylidencamphers, der 4-Aminobenzoesäure, der Zimtsäure, der Salicylsäure, des Benzophenons sowie auch des 2-Phenylbenzimidazols handelt.

Auch für den Bereich zwischen etwa 320 nm und etwa 400 nm, den sogenannten UVA-Bereich, ist es wichtig, Filtersubstanzen zur Verfügung zu haben, da auch dessen Strahlen Schäden hervorrufen können. So ist erwiesen, daß UVA-Strahlung zu einer Schädigung d r lastischen und kollagenen Fas m des Bindegewebes führt, was die Haut vorz itig altern läßt, und daß sie als Ursache zahlreicher phototoxischer



und photoall rgischer R aktion n zu sehen ist. Der schädigende Einfluß der UVB-Strahlung kann durch UVA-Strahlung verstärkt werden.

Die UV-Strahlung kann aber auch zu photochemischen Reaktionen führen, wobei dann die photochemischen Reaktionsprodukte in den Hautmetabolismus eingreifen.

Vorwiegend handelt es sich bei solchen photochemischen Reaktionsprodukten um radikalische Verbindungen, z.B. Hydroxylradikale. Auch undefinierte radikalische Photoprodukte, welche in der Haut selbst entstehen, können aufgrund ihrer hohen Reaktivität unkontrollierte Folgereaktionen an den Tag legen. Aber auch Singulettsauerstoff, ein nichtradikalischer angeregter Zustand des Sauerstoffmoleküls kann bei UV-Bestrahlung auftreten, ebenso kurzlebige Epoxide und viele Andere. Singulettsauerstoff beispielsweise zeichnet sich gegenüber dem normalerweise vorliegenden Triplettsauerstoff (radikalischer Grundzustand) durch gesteigerte Reaktivität aus. Allerdings existieren auch angeregte, reaktive (radikalische) Triplettzustände des Sauerstoffmoleküls.

Ferner zählt UV-Strahlung zur ionisierenden Strahlung. Es besteht also das Risiko, daß auch ionische Spezies bei UV-Exposition entstehen, welche dann ihrerseits oxidativ in die biochemischen Prozesse einzugreifen vermögen.

Ein vorteilhafter UVB-Filter ist der 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoesäure-tris(2-ethylhexylester), synonym: 2,4,6-Tris-[anilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)]-1,3,5-triazin.

Diese UVB-Filtersubstanz wird von der BASF Aktiengesellschaft unter der Warenbezeichnung UVINUL® T 150 vertrieben und zeichnet sich durch gute UV-Absorptionseigenschaften aus.

Der Hauptnachteil dieses UVB-Filters ist die schlechte Löslichkeit in Lipiden. Bekannte Lösungsmittel für diesen UVB-Filter können maximal ca. 15 Gew.-% dieses Filters lösen, entsprechend etwa 1 - 1,5 Gew.-% gelöster, und damit aktiver, UV-Filtersubstanz.

Es war indes überraschend und für den Fachmann nicht vorauszusehen, daß Wirkstoffkombinationen aus 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoesäuretris(2-ethylhexylester) und einem oder mehreren Estern unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole, bzw. die Verwendung von einem oder mehreren Estern unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole als Lösungsmittel, Lösungsvermittler oder Solubilisator für 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoesäure-tris(2-ethylhexylester), insbesondere für die Verwendung in Lichtschutzmitteln, den Nachteilen des Standes der Technik Abhilfe schaffen würden.

Die erfindungsgemäßen Ester unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole können vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der Substanzen der allgemeinen Formel

in welcher R<sub>1</sub> einen unverzweigtkettigen Alkylrest mit 3 bis 30 Kohlenstoffatomen darstellt, und R<sub>2</sub> einfach bzw. mehrfach verzweigte Alkylreste mit 3 bis 30 Kohlenstoffatomen darstellt.

Vorteilhaft stellt R<sub>1</sub> einen unverzweigtkettigen Alkylrest mit bis zu 20 Kohlenstoffatomen dar.

Weiter vorteilhaft stellt  $R_2$  einen einfach oder mehrfach verzweigten Alkylrest mit bis zu 25 Kohlenstoffatomen dar.

Ganz besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung liegen der oder die Carbonsäureester im Gemisch mit den zugrundeliegenden Alkoholen R<sub>2</sub>-OH vor.

Besonders vorteilhaft ist es, als erfindungsgemäß verwendete Carbonsäureester Hexyldecyllaurat, beispielsweise im Gemisch mit Hexyldecylalkohl, einzusetzen. Ein solches Gemisch ist in den Chemical Abstracts unter den Registraturnummern 70693-04-8 und 34362-27-1 verzeichnet und wird beispielsweise von der Gesellschaft Henkel KGaA unter der Bezeichnung Cetiol®PGL verkauft. In kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen kann es bekannterweise als Ölkomponente Verwendung finden.

Es war indes erstaunlich, daß durch Zugabe von einem oder mehreren Estern unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole eine Stabilisierung von Lösungen des 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoesäure-tris(2-ethylhexylester) bewirkt wird, da die letztere Substanz nicht nur schlechte Löslichkeit aufweist, sondern auch aus seiner Lösung leicht wieder auskristallisiert. Erfindungsgemäß ist daher auch ein Verfahren zur Stabilisierung von Lösungen des 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoesäure-tris(2-ethylhexylester), dadurch gekennzeichnet, daß solchen Lösungen ein wirksamer Gehalt an einem oder mehreren Estern unverzweigtk ttiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole zugesetzt wird.

Di G samtm ng an 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoesäure-tris(2-ethylhexylester) in d n fertigen kosmetisch n oder dermatologischen Zubereitungen wird vorteilhaft aus d m B reich von 0,1 - 10,0 Gew.-%, bevorzugt 0,5 - 6,0 Gew.-% gewählt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Die Gesamtmenge an einem oder mehreren Estern unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole in den fertigen kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen wird vorteilhaft aus dem Bereich von 0,1 - 25,0 Gew.-%, bevorzugt 0,5 - 15,0 Gew.-% gewählt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

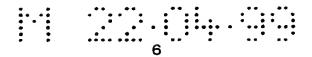
Es ist von Vorteil, Gewichtsverhältnisse von 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoesäure-tris(2-ethylhexylester) und einem oder mehreren Estern unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole aus dem Bereich von 1 : 10 bis 10 : 1, bevorzugt 1 : 4 bis 4 : 1, zu wählen.

Erfindungsgemäße kosmetische und dermatologische Zubereitungen enthalten vorteilhaft außerdem anorganische Pigmente auf Basis von Metalloxiden und/oder anderen in Wasser schwerlöslichen oder unlöslichen Metallverbindungen, insbesondere der Oxide des Titans (TiO<sub>2</sub>), Zinks (ZnO), Eisens (z.B. Fe<sub>2</sub>O<sub>3</sub>), Zirkoniums (ZrO<sub>2</sub>), Siliciums (SiO<sub>2</sub>), Mangans (z.B. MnO), Aluminiums (Al<sub>2</sub>O<sub>3</sub>), Cers (z.B. Ce<sub>2</sub>O<sub>3</sub>), Mischoxiden der entsprechenden Metalle sowie Abmischungen aus solchen Oxiden. Besonders bevorzugt handelt es sich um Pigmente auf der Basis von TiO<sub>2</sub>.

Es ist besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, wenngleich nicht zwingend, wenn die anorganischen Pigmente in hydrophober Form vorliegen, d.h., daß sie oberflächlich wasserabweisend behandelt sind. Diese Oberflächenbehandlung kann darin bestehen, daß die Pigmente nach an sich bekannten Verfahren mit einer dünnen hydrophoben Schicht versehen werden.

Eines solcher Verfahren besteht beispielsweise darin, daß die hydrophobe Oberflächenschicht nach einer Reaktion gemäß

 $n TiO_2 + m (RO)_3 Si-R' -> n TiO_2 (oberfl.)$ 



erzeugt wird. n und m sind dabei nach Belieben inzus tzende stöchiometrische Parameter, R und R' di g wünschten organisch n R ste. Beispielsweise in Analogie zu DE-OS 33 14 742 dargestellte hydrophobisierte Pigmente sind von Vorteil.

Vorteilhafte TiO<sub>2</sub>-Pigmente sind beispielsweise unter den Handelsbezeichnungen MT 100 T von der Firma TAYCA, ferner M 160 von der Firma Kemira sowie T 805 von der Firma Degussa erhältlich.

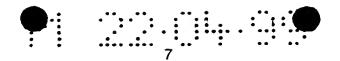
Die erfindungsgemäßen kosmetischen und/oder dermatologischen Lichtschutzformulierungen können wie üblich zusammengesetzt sein und dem kosmetischen und/oder dermatologischen Lichtschutz, ferner zur Behandlung, der Pflege und der Reinigung der Haut und/oder der Haare und als Schminkprodukt in der dekorativen Kosmetik dienen.

Zur Anwendung werden die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen in der für Kosmetika üblichen Weise auf die Haut und/oder die Haare in ausreichender Menge aufgebracht.

Besonders bevorzugt sind solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen. Vorteilhaft können diese zusätzlich mindestens einen weiteren UVA-Filter und/oder mindestens einen weiteren UVB-Filter und/oder mindestens ein anorganisches Pigment, bevorzugt ein anorganisches Mikropigment, enthalten.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Hilfsstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z.B. Konservierungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die eine färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikonderivate.

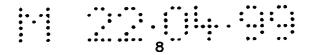
Ein zusätzlich r G halt an Antioxidantien ist im allgemeinen bevorzugt. Erfindungsgemäß können als günstige Antioxidantien alle für kosmetisch und/oder dermatologi-



sche Anwendung n g ign ten oder gebräuchlichen Antioxidantien v rwendet werden.

Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z.B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z.B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z.B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z.B. α-Carotin, β-Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Chlorogensäure und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z.B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z.B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ-Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z.B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z.B. pmol bis µmol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z.B. α-Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α-Hydroxysäuren (z.B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z.B. γ-Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Furfurylidensorbitol und dessen Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z.B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z.B. Vitamin-E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin-A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate, α-Glycosylrutin, Ferulasäure, Furfurylidenglucitol, Camosin, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroquajakharzsäure, Nordihydroquajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z.B. ZnO, ZnSO<sub>4</sub>) Selen und dessen Derivate (z.B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z.B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Die Menge der vorg nannten Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05



- 20 Gew.-%, insb sond re 1 - 10 Gew.-%, b zogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Sofern Vitamin E und/oder dessen Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.

Sofern Vitamin A, bzw. Vitamin-A-Derivate, bzw. Carotine bzw. deren Derivate das oder die Antioxidantien darstellen, ist vorteilhaft, deren jeweilige Konzentrationen aus dem Bereich von 0,001 - 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, zu wählen.



Die Lipidphase kann vorteilhaft gewählt werden aus folgender Substanzgruppe:

- Mineralöle, Mineralwachse
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl:
- Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z.B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- Alkylbenzoate;
- Silikonöle wie Dimethylpolysiloxane, Diethylpolysiloxane, Diphenylpolysiloxane sowie Mischformen daraus.

Die Ölphase der Emulsionen, Oleogele bzw. Hydrodispersionen oder Lipodispersionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylst arat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, Eru-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyloleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Eru-



cylerucat sowie synth tisch , halbsynthetische und natürliche G misch solcher Ester, z.B. Jojobaöl.

Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silkonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z.B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isoeicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus  $C_{12-15}$ -Alkybenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus  $C_{12-15}$ -Alkybenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus  $C_{12-15}$ -Alkybenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

Vorteilhaft wird Cyclom thicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendend s Silikonöl ingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vort ilhaft im

Sinne dir vorli genden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexam thylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

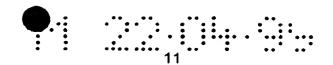
Die wäßrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft

Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether. vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl, monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder monoethylether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z.B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate. z.B. Hyaluronsäure, Xanthangummi, pylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carbopole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination.

Die kosmetischen oder dermatologischen Lichtschutzzubereitungen enthalten vorteilhaft anorganische Pigmente, insbesondere Mikropigmente, z.B. in Mengen von 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise in Mengen von 0,5 Gew.-% bis 10 Gew.-%, insbesondere aber 1 Gew.-% bis 6 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Es ist erfindungsgemäß vorteilhaft, außer den erfindungsgemäßen Kombinationen öllösliche UVA-Filter und/oder UVB-Filter in der Lipidphase und/oder wasserlösliche UVA-Filter und/oder UVB-Filter in der wäßrigen Phase einzusetzen.

Vorteilhaft können die erfindungsgemäßen Lichtschutzformulierungen weitere Substanzen enthalt n. die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z.B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1 bis 6 Gew.-% beträgt, bezogen auf das



Gesamtgewicht d r Zub r itungen, um kosmetische Zubereitung n zur Verfügung zu stellen, die die Haut vor d m g samten Bereich d r ultravioletten Strahlung schützen. Sie könn n auch als Sonnenschutzmittel dien n.

Die weiteren UVB-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Vorteilhafte öllösliche UVB-Filtersubstanzen sind z.B.:

- 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoesäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoesäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoesäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;

Vorteilhafte wasserlösliche UVB-Filtersubstanzen sind z.B.:

- Salze der 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure wie ihr Natrium-, Kalium- oder ihr Triethanolammonium-Salz, sowie die Sulfonsäure selbst;
- Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxy-benzophenon-5-sulfonsäure und deren Salze;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z.B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure,2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und deren Salze.

Die Liste der genannten weiteren UVB-Filter, die in Kombination mit den erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen verwendet werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

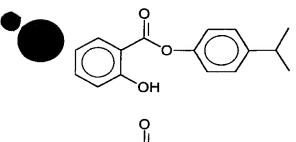
Es kann auch von Vorteil sein, die erfindungsgemäßen Kombinationen mit weiteren UVA-Filtern zu kombinieren, die bisher üblicherweise in kosmetischen Zubereitungen enthalten sind. Bei diesen Substanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insb sond re um 1-(4'-tert.Butylph nyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Auch diese



Kombination n bzw. Zub reitungen, die di s Kombinationen enthalt n, sind G genstand der Erfindung. Es können die für di UVB-Kombination verwendeten Mengen eingesetzt werden.

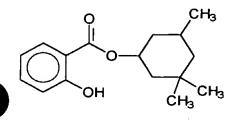
Ferner ist vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen mit weiteren UVA- und/oder UVB-Filtern zu kombinieren.

Es ist auch besonders vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen mit Salicylsäurederivaten zu kombinieren, von denen einige Vertreter bekannt sind, welche ebenfalls UV-Strahlung absorbieren können. Zu gebräuchlichen UV-Filtern gehören



(4-Isopropylbenzylsalicylat),

(2-Ethylhexylsalicylat, Octylsalicylat).



(Homomenthylsalicylat).

Gegenstand der Erfindung ist auch ein Verfahren zur Herstellung der erfindungsgemäßen kosmetischen und/oder dermatologischen Lichtschutzzubereitungen, das dadurch gekennzeichnet ist, daß man in an sich bekannter Weise den 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoesäure-tris(2-ethylhexylester) in einem oder mehreren Estern unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole oder einer Ölphase mit einem Gehalt an einem oder mehreren Estern unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole bei gleichmäßigem Rühren und gegebenenfalls unter Erwärmen suspendiert und gewünschtenfalls homogenisiert, gegebenenfalls mit weit rin Lipidkomponenten und gegibenenfalls mit einem oder mehren.

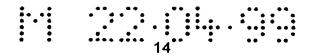


reren Emulgatoren v reinigt, hemach die Ölphase mit der wäßrig n Phase, in w Iche gegebenenfalls in V rdickungsmitt I eingearbeitet worden ist, und welche vorzugswis etwa di gl ich Temperatur besitzt wi di Ölphas, v rmischt, g wünschtenfalls homogenisiert und auf Raumtemperatur abkühlen läßt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur kann, insbesondere, wenn noch flüchtige Bestandteile eingearbeitet werden sollen, nochmaliges Homogenisieren erfolgen.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen, öhne sie einzuschränken. Alle Mengenangaben, Anteile und Prozentanteile sind, soweit nicht anders angegeben, auf das Gewicht und die Gesamtmenge bzw. auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen bezogen.







Gew.-%

#### B ispi 11

#### O/W-Emulsion

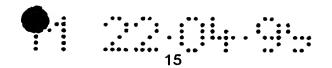
	Gew%
Stearinsäure	3,50
Glycerin	3,00
Cetylstearylalkohol	0,50
Dicaprylylether	8,00
Uvinul®T150	5,00
Hexyldecyllaurat	12,00
Natriumhydroxid (45%ig)	0,33
Carbomer	0,20
Konservierungsmittel	q.s.
Parfum	q.s.
Wasser, demin.	ad 100,00

#### Beispiel 2

W/O-Emulsion

Arlacel®989	5,50
Butylenglykol	5,00
Hexyldecyllaurat	12,00
Uvinul®T150	5,00
Cetylstearylisononanoat	6,00
Carbomer	0,20
Konservierungsmittel	q.s.
Parfum	q.s.
Wasser, demin.	ad 100,00





## <u>B ispi | 3</u>

Hydrodisp rsionsgel

	Gew%
Carbomer	0,50
Butylenglykol	5,00
Hexyldecyllaurat	10,00
Natriumhydroxid (45%ig)	0,35
Uvinul®T150	5,00
Hydroxypropylcellulose	0,60
Konservierungsmittel	q.s.
Parfum	q.s.
Wasser, demin.	ad 100,00



#### Patentansprüch:

- 1. Wirkstoffkombinationen aus 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoesäure-tris(2-ethylhexylester) und einem oder mehreren Estern unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole.
- 2. Verwendung von einem oder mehreren Estern unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole als Lösungsmittel, Lösungsvermittler oder Solubilisator für 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoesäure-tris(2-ethylhexylester), insbesondere für die Verwendung in Lichtschutzmitteln.
- 3. Kombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß die Gesamtmenge an 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-trisbenzoesäure-tris(2-ethylhexylester) in den fertigen kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen aus dem Bereich von 0,1 10,0 Gew.-%, bevorzugt 0,5 6,0
  Gew.-% gewählt wird, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.
  - 4. Kombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß der oder die Ester verzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole im Gemisch mit den zugrundeliegenden Alkoholen R<sub>2</sub>-OH vorliegen.
  - 5. Kombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß als Ester verzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole das Hexyldecyllaurat gewählt wird.
  - 6. Kombinationen nach Anspruch 1 oder Verwendung nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß die Gesamtmenge an einem oder mehreren Estern unverzweigtkettiger Carbonsäuren und verzweigtkettiger Alkohole in den fertigen kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen aus dem Bereich von 0,1 - 25,0 Gew.-%, bevorzugt 0,5 - 15,0 Gew.-% gewählt wird, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.



### Zusammenfassung:

Wirkstoffkombinationen aus 4,4',4"-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzo säure-tris(2-ethylhexylester) und einem oder mehreren Estem unverzweigtkettiger Carbon-säuren und verzweigtkettiger Alkohole.



